

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号
特開2001-220336
(P2001-220336A)

(43) 公開日 平成13年8月14日 (2001.8.14)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	デフォルト* (参考)	
A 6 1 K	7/22	A 6 1 K	7/22	4 B 0 1 4
	7/24		7/24	4 C 0 8 3
	7/26		7/26	
// A 2 3 G	3/30	A 2 3 G	3/30	

審査請求 未請求 請求項の数 1 O L (全 8 頁)

(21) 出願番号 特願2000-30556(P2000-30556)

(22) 出願日 平成12年2月8日 (2000.2.8)

(71) 出願人 000006769

ライオン株式会社

東京都墨田区本所1丁目3番7号

(72) 発明者 平塚 進

東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオン株式会社内

(72) 発明者 荒谷 祐子

東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオン株式会社内

(74) 代理人 100079304

弁理士 小島 隆司 (外1名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 口腔用組成物

(57) 【要約】

【解決手段】 (A) アスコルビン酸又はその誘導体と、(B) 2つ以上の水酸基を有するアミン化合物とを含有してなることを特徴とする口腔用組成物。

【効果】 本発明の口腔用組成物は、アスコルビン酸及びその誘導体の経時による残存率の低下が抑制され、安定性の高いものである。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 (A) アスコルビン酸又はその誘導体と、(B) 2つ以上の水酸基を有するアミン化合物とを含有してなることを特徴とする口腔用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、アスコルビン酸又はその誘導体の経時による残存率の低下を防止した口腔用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術及び発明が解決しようとする課題】アスコルビン酸及びその誘導体は、歯周疾患予防・治療のための有効成分として知られ、従来よりアスコルビン酸やその誘導体を配合した口腔用組成物が種々提案されている（特開昭62-96408号、同62-273910号、特開平1-211520号、同4-217616号、同4-217617号、同4-217618号、同4-275213号公報）。

【0003】しかしながら、アスコルビン酸及びその誘導体は、口腔用組成物に配合した場合、経時によりその残存率が低下する問題があり、このためアスコルビン酸及びその誘導体を口腔用組成物に安定配合する技術の開発が望まれる。

【0004】この場合、アスコルビン酸又はその誘導体を配合した口腔用組成物は、組成物の変色の問題があり、この変色を抑制するための提案（特開昭52-79032号、同63-141921号、特開平3-127720号公報）も種々なされているが、これらの提案は、その変色の原因であると思われるアスコルビン酸及びその誘導体の分解を抑制し、残存率の低下を防止して、配合の安定化を計るものとは相違する。

【0005】従って、本発明は、アスコルビン酸又はその誘導体の経時による残存率の低下を防止することができ、アスコルビン酸又はその誘導体が安定化配合された口腔用組成物を提供することを目的とする。

【0006】

【課題を解決するための手段及び発明の実施の形態】本発明者は、上記目的を達成すべく、アスコルビン酸又はその誘導体の保存安定性を向上させるために鋭意研究を進めた結果、2つ又はそれ以上の水酸基を有するアミン化合物を配合すると、アスコルビン酸又はその誘導体の残存率の低下が起りにくくなり、安定化に効果があることを知見し、本発明をなすに至った。

【0007】以下、本発明につき更に詳しく説明する。本発明の口腔用組成物は、アスコルビン酸又はその誘導体を含有する。この場合、アスコルビン酸及びその誘導体としては、アスコルビン酸、アスコルビン酸の2, 3, 5, 6位のいずれかの水酸基の1つ又は2つ以上がリン酸、ポリリン酸、硫酸、脂肪酸、その他薬学上許容される化合物のエステルとなったものが使用できる。例

えば、アスコルビン酸-2-リン酸エステル、アスコルビン酸-3-リン酸エステル、アスコルビン酸-6-リン酸エステル、アスコルビン酸-2-ポリリン酸エステル、アスコルビン酸-2-硫酸エステル、アスコルビン酸-2-パルミチン酸エステル、アスコルビン酸-6-パルミチン酸エステル、アスコルビン酸-2-ステアリン酸エステル、アスコルビン酸-6-ステアリン酸エステル、アスコルビン酸-2, 6-ジブチルエステル、アスコルビン酸-2, 6-パルミチン酸エステル等が挙げられる。また、それらの塩類としては、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等が挙げられる。

【0008】これらアスコルビン酸及びその誘導体は、1種又は2種以上の組み合わせで配合でき、アスコルビン酸誘導体の中では特に、組成物の安定性の面から、アスコルビン酸の2又は3位の水酸基がエステル化されたものが好ましく用いられる。

【0009】アスコルビン酸及びその誘導体の配合量は、組成物全体の0.001~10%（質量百分率、以下同じ）、特に0.01~5%が好ましい。0.001%に満たない場合は効果が十分でない場合があり、逆に10%を超えると口腔用組成物の使用感に悪影響を与える場合がある。

【0010】本発明の口腔用組成物においては、アスコルビン酸又はその誘導体の安定化剤として、2つ又はそれ以上の水酸基を有するアミン化合物を配合する。このアミン化合物としては、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、N-エチルジエタノールアミン、ジプロパノールアミン、トリプロパノールアミンなどが挙げられる。これらのアミン化合物の配合量は、組成物全体の0.001~10%の範囲で配合でき、特に0.1~5%配合することが望ましい。またこの場合、上記アミン化合物は、アスコルビン酸又はその誘導体1重量部に対して1~25重量部の割合で配合することが望ましい。

【0011】本発明の口腔用組成物は、例えば練歯磨剤、液状歯磨剤、液体歯磨剤、潤滑歯磨剤、粉歯磨剤等の歯磨剤類、洗口剤、タブレット、口中清涼剤、チューインガム、パスタ、義歯用洗浄剤等として好適に調製されるもので、その剤型に応じ、上記必須成分以外に任意成分としてその他の添加剤を配合することができる。

【0012】即ち、歯磨剤に用いられる場合、研磨剤、粘潤剤、甘味剤、防腐剤、色素、pH調整剤、各種有効成分、香料、溶剤等の成分を混合して製造することができる。

【0013】ここで、研磨剤としては、沈降性シリカ、シリカゲル、アルミノシリケート、ジルコノシリケート等のシリカ系研磨剤、水酸化アルミニウム、リン酸水素カルシウム2水塩及び無水塩、ピロリン酸カルシウム、メタリン酸ナトリウム、ハイドロキシアパタイト、重質及び軽質炭酸カルシウム、ケイ酸ジルコニウム、アルミ

ナ、炭酸マグネシウム、第3リン酸マグネシウム、合成樹脂系研磨剤等が好適に用いられる。

【0014】また、グリセリン、ソルビット、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、キシリット、マルチット、ラクチット等の粘稠剤、カルボキシメチルセルロースナトリウム、カラギーナン、アルギン酸ナトリウム、ポリアクリル酸ナトリウム、カーボボール、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、メチルセルロース、モンモリロナイト、グアガム、ビーガム、トラヤガム、アラビアガム、ローカストビーンガム、ゼラチン、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、メトキシエチレンと無水マレイン酸の共重合体、ラボナイト、増粘性シリカ等の他の粘結剤、脂肪酸系、直鎖アルキルベンゼン系、アルファオレフィン系、ノルマルパラフィン系、高級アルコール系のアニオン界面活性剤、ショ糖脂肪酸エステル、脂肪酸アルカノールアミド、ポリグリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレン多価アルコール脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン界面活性剤、イミダゾリン系、ベタイン系等の両イオン界面活性剤、アミン系、第4級アンモニウム塩系の陰イオン界面活性剤からなる発泡剤及び発泡助剤、サッカリンナトリウム、ステビオサイド、ステビアエキス、パラメトキシシンナミックアルデヒド、ネオヘスベリジルジヒドロカルコン、ペリラルチン、アスパラチルフェニルアラニンメチルエステル、タウマチン、パラチノース、甘草粉末等の甘味剤、パラオキシ安息香酸エステル、安息香酸ナトリウム、低級脂肪酸モノグリセリド、p-ヒドロキシベンゾイックアシド等の防腐剤、青色1号、青色2号、青色201号、青色205号、緑色3号、緑色201号、緑色202号、緑色204号、黄色4号、黄色5号、黄色203号、赤色2号、赤色213号、カラメル色素、二酸化チタン等の色素、正リン酸のアルカリ金属塩、クエン酸のアルカリ金属塩等のようなpH緩衝作用を有する物質のほか、塩酸、水酸化ナトリウム等の酸及びアルカリからなるpH調整剤、1-メントール、カルボン、リモネン、アネトール等のテルペン類又はその誘導体等の香料、水、エタノール、セタノール等の溶剤が例示される。

【0015】各種有効成分としては、フッ化ナトリウム、フッ化第1錫、フッ化カリウム、フッ化アンモニウム、モノフルオロリン酸ナトリウム等のフッ化物、アラントイン、アラントインクロヒドロキシアルミニウム、グリチルリチン酸及びその塩類、酢酸及びニコチン酸トコフェロール、ゼオライト、ポリリン酸ナトリウム、ピロリン酸ナトリウム、トラネキサム酸、イブシロンアミノカプロン酸、4-アミノメチルシクロヘキサンカルボン酸、β-グリチルレチン酸、塩化リゾチム、

α-ビスボロール、イブプロフェン、アズレン、グアイアズレンスルホン酸ナトリウム、エビジヒドロコレステリン、タウリン、塩化ナトリウム、デキストラナーゼ、ムタナーゼ、アミラーゼ、溶菌酵素、乳酸アルミニウム、塩化ストロンチウム、硝酸カリウム、ジヒドロコレスタノール、トリクロロカルバニリド、ミカン科植物やキンボウゲ科植物抽出物のようなベルベリン含有植物抽出物、トウキ軟エキスを、オウバク、チョウジ、オウゴン、ローズマリー、ベニバナ、カミツレなどの抽出物、ルチン又はその誘導体、ヒドロキサム酸及びその誘導体、銅クロロフィリンナトリウム、重曹、クエン酸亜鉛、ハロゲン化ジフェニルエーテル、イソプロピルメチルフェノール、チモール、ヒノキチオール、塩化セチルピリジニウム、塩化ベンゼトニウム、塩化ベンザルコニウム、塩化デカリニウム、塩酸及びグルコン酸クロルヘキシジン等が例示される。

【0016】なお、アスコルビン酸及びその誘導体は、酸化分解を起こしやすいため、過酸化物質などの酸化剤は配合しないことが望ましい。

【0017】更に、洗口剤、義歯安定剤、口腔用ペースタ、口中清涼剤等、歯磨剤以外の口腔用組成物に用いる成分として、上記以外には、流動パラフィン、マイクロクリスタリンワックス、パラフィンワックス、デンブ、コーンスターチ、乳糖、粉糖、ガムベース、水飴等が例示される。

【0018】なお、これらの任意成分の配合量は、本発明の効果を妨げない範囲で通常量とすることができる。

【0019】本発明の口腔用組成物は、容器として、アルミニウムラミネートチューブ、ガラス蒸着プラスチックチューブ等のチューブのほか、機械的又は差圧によるディスペンサー容器、ピロー包装等のフィルム包装容器、射出、中空、プレス、真空等の成形によるボトル等にも充填することができる。

【0020】

【発明の効果】本発明の口腔用組成物は、アスコルビン酸及びその誘導体の経時による残存率の低下が抑制され、安定性の高いものである。

【0021】

【実施例】以下、実験例及び実施例を示し、本発明を具体的に説明するが、本発明は下記の実施例に制限されるものではない。

【0022】〔実験例〕下記の歯磨剤基剤に下記のアミン化合物、又はその比較として類似構造のグリコール類を配合した歯磨剤、及びコントロールとしてブランク製剤を作製した。これら計6組成の歯磨剤各90gをアルミラミネートチューブに入れ、40℃恒温槽中に保存し、6ヶ月後のアスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩の残存率を測定した。結果を下記に示す。

【0023】

歯磨剤基剤

プロピレングリコール	3	%
カルボキシメチルセルロース	2	%
パラベン	0.8	%
アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩	0.1	%
サッカリンナトリウム	0.2	%
ソルビット	30	%
無水ケイ酸	15	%
香料	1	%
ラウリル硫酸ナトリウム	1.2	%
水	残	

添加した化合物

トリエタノールアミン	3.0	%
ジエタノールアミン	3.0	%
エチレングリコール	3.0	%
エタノールアミン	3.0	%
ジエチレングリコール	3.0	%

【0024】

<各サンプルのアスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩残存率>

(1) トリエタノールアミン	94.9	%
(2) ジエタノールアミン	92.7	%
(3) エチレングリコール	75.1	%
(4) エタノールアミン	59.9	%
(5) ジエチレングリコール	79.6	%
(6) コントロール	80.3	%

【0025】以下、実施例を示す。

〔実施例1〕 練歯磨

プロピレングリコール	5	%
ソルビット	40	
カラギーナン	1.2	
サッカリンナトリウム	0.2	
ラウリル硫酸ナトリウム	1.2	
パラオキシ安息香酸エチル	0.1	
アスコルビン酸-2-リン酸エステルマグネシウム塩	0.2	
クエン酸1水和物	0.2	
トリエタノールアミン	3	
水酸化ナトリウム	0.05	
無水ケイ酸	15	
香料	0.9	
精製水	残	
計	100.0	%

【0026】

〔実施例2〕 練歯磨

ポリエチレングリコール400	5	%
グリセリン	20	
キサンタンガム	1.1	
キシリット	10	
ラウリル硫酸ナトリウム	0.9	
ミリスチン酸ジエタノールアミド	0.6	
パルミチン酸	0.5	

アスコルビン酸-2-リン酸エステルナトリウム塩	1	
クエン酸1水和物	0.5	
ジエタノールアミン	0.5	
パラオキシ安息香酸エチル	0.1	
水酸化アルミニウム	40	
香料	1.2	
精製水	残	
計	100.0	%

【0027】

〔実施例3〕 練歯磨		
プロピレングリコール	4	%
ソルビット	40	
カルボキシメチルセルロース	2	
サッカリンナトリウム	0.15	
ラウリル硫酸ナトリウム	1	
ラウロイルサルコシンナトリウム	0.2	
安息香酸ナトリウム	0.8	
水酸化ナトリウム	0.05	
トラネキサム酸	0.1	
アスコルビン酸脂肪酸エステル	0.05	
酒石酸ナトリウム	0.02	
トリエタノールアミン	1	
ミリスチン酸ナトリウム	0.2	
チタニウム結合性シリカ	20	
香料	1	
精製水	残	
計	100.0	%

【0028】

〔実施例4〕 練歯磨		
プロピレングリコール	5	%
ソルビット	35	
アルギン酸ナトリウム	3	
サッカリンナトリウム	0.15	
ラウリル硫酸ナトリウム	1	
パラオキシ安息香酸ブチル	0.5	
水酸化ナトリウム	0.05	
トリクロサン	0.1	
アスコルビン酸-3-リン酸エステル	0.05	
トリエタノールアミン	2	
ジエタノールアミン	1	
トリポリリン酸	1	
ミリスチン酸ナトリウム	0.2	
無水ケイ酸	20	
香料	1	
精製水	残	
計	100.0	%

【0029】

〔実施例5〕 練歯磨		
ポリアクリル酸ナトリウム	0.5	%
キサンタンガム	0.5	

プロピレングリコール	5	
70%ソルビット液	20	
サッカリンナトリウム	0.1	
安息香酸ナトリウム	0.3	
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5	
トラネキサム酸	0.1	
アスコルビン酸-2-リン酸エステルナトリウム塩	0.5	
トリエタノールアミン	2.5	
酒石酸	2	
d1- α -トコフェロール	0.2	
オウバクエキス	0.05	
フッ化ナトリウム	0.2	
無水ケイ酸	20	
香料	1	
精製水	残	
計	100.0	%

【0030】

〔実施例6〕 液状歯磨剤

無水ケイ酸	10	%
キサンタンガム	1	
サッカリンナトリウム	0.1	
60%ソルビット液	40	
グリセリン	20	
プロピレングリコール	3	
ラウリル硫酸ナトリウム	1.2	
炭酸水素ナトリウム	2	
ラウリン酸デカグリセリル	0.5	
フッ化ナトリウム	0.2	
トリクロサン	0.1	
アスコルビン酸-2-リン酸エステルマグネシウム塩	1.5	
トリエタノールアミン	0.5	
香料	0.8	
青色1号	0.001	
精製水	残	
計	100.0	%

【0031】

〔実施例7〕 口腔用バスタ

セタノール	20	%
スクワラン	5	
P. O. E (40) 硬化ヒマシ油	0.1	
ソルビタンモノオレイン酸エステル	1	
ラウリル硫酸ナトリウム	0.2	
グリチルレチン酸	0.1	
サッカリンナトリウム	0.6	
アスコルビン酸リン酸エステル	0.3	
クエン酸	0.5	
ジエタノールアミン	0.5	
リン酸水素カルシウム	5	
香料	0.3	
精製水	残	

【0032】	計	100.0 %
	〔実施例8〕 洗口剤	
	エタノール	5 %
	ソルビット	10
	ショ糖モノパルミテート	0.2
	P. O. E (60) 硬化ヒマシ油	0.1
	パラオキシ安息香酸メチル	0.01
	サッカリンナトリウム	0.7
	トラネキサム酸	0.5
	塩化セチルビリジニウム	0.2
	アスコルビン酸-2-硫酸エステルナトリウム塩	0.2
	クエン酸	0.5
	ジエタノールアミン	0.5
	モノフルオロリン酸ナトリウム	0.7
	オウバクエキス	0.1
	香料	1
	精製水	残
	計	100.0 %
【0033】		
	〔実施例9〕 マウスウォッシュ	
	エタノール	10 %
	グリセリン	10
	P. O. E (60) 硬化ヒマシ油	5
	サッカリンナトリウム	0.7
	トラネキサム酸	0.15
	アスコルビン酸-2-リン酸エステルマグネシウム塩	1
	酒石酸ナトリウム	0.5
	トリエタノールアミン	0.25
	香料	1
	精製水	残
	計	100.0 %
【0034】		
	〔実施例10〕 チューインガム	
	ガムベース	25 %
	キシリトール	10
	砂糖	15
	イソマルトース	20
	コーンシロップ	16
	アスコルビン酸	0.15
	アスコルビン酸脂肪酸エステル	0.2
	クエン酸3ナトリウム	0.1
	トリエタノールアミン	0.25
	パルミチン酸	0.2
	香料	0.6
	水飴	残
	計	100.0 %

フロントページの続き

(72)発明者 山本 瑞哉
東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオ
ン株式会社内

Fターム(参考) 4B014 GB13 GL04 GL08
4C083 AA112 AB032 AB172 AB222
AB242 AB292 AB312 AB472
AC022 AC072 AC102 AC112
AC122 AC132 AC242 AC302
AC312 AC422 AC432 AC442
AC482 AC541 AC542 AC622
AC642 AC662 AC692 AC782
AC792 AC812 AC862 AD042
AD092 AD222 AD302 AD352
AD532 AD641 AD642 AD662
CC41 DD22 DD23 DD27 EE01
EE07 EE33

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record.**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☒ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.